

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
26. Mai 2005 (26.05.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 2005/047276 A3**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 309/30

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/012659

(22) Internationales Anmeldedatum:  
9. November 2004 (09.11.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
103 52 659.5 11. November 2003 (11.11.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von  
US): RATIOPHARM GMBH [DE/DE]; Graf-Arco-Str.  
3, 89079 Ulm (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TARAROV, Vitali  
[RU/RU]; Chertanovskaya Str. 51-3-275, Moskau (RU).  
KÖNIG, Gerd [DE/DE]; Am Fuchsgraben 11 F, 08056  
Zwickau (DE). BÖRNER, Armin [DE/DE]; Im Winkel  
40, 18059 Rostock (DE).

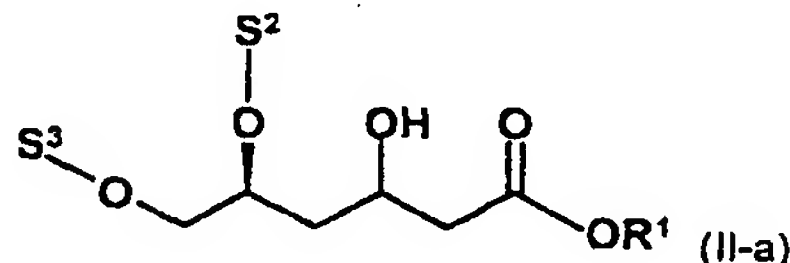
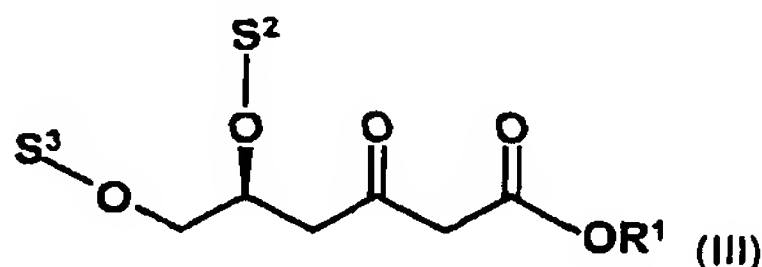
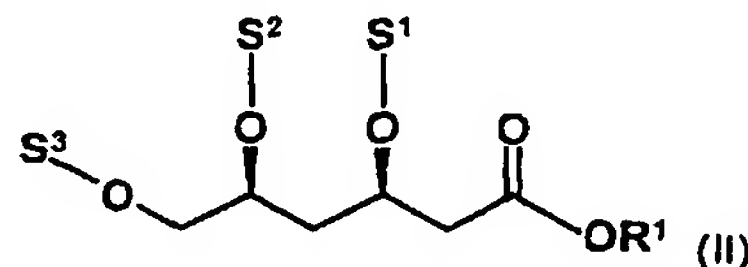
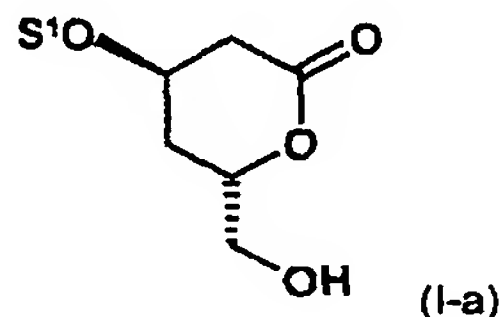
(74) Anwälte: BEST, Michael usw.; Lederer & Keller, Prinzre-  
gentenstr. 16, 80538 München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für  
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,  
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,  
CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,  
GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHOD FOR THE PRODUCTION OF STATINS

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON STATINEN



(57) Abstract: The invention relates to a method for the production of a statin. Said method comprises the following steps: a) a compound of formula (II) is produced, wherein S<sup>1</sup> represents a hydrogen atom or a hydroxyl protective group, S<sup>2</sup> and S<sup>3</sup> independently represent a hydroxyl protective group and R<sup>1</sup> represents a hydrogen atom or a carboxyl protective group. Said compound of formula (II) is produced by stereoselective hydrogenation of a compound of formula (III) in order to form a compound of formula (II-a) and, optionally, by introducing a hydroxyl protective group. b) by lactonising the compound of formula (II) in order to form a compound of formula (I-a).

(57) Zusammenfassung: Erfindungsgemäß wird ein Verfahren zur Herstellung eines Statins zur Verfügung gestellt, umfassend die folgenden Schritte: a) Herstellung einer Verbindung der Formel (II), in der S<sup>1</sup> ein Wasserstoffatom oder eine Hydroxylschutzgruppe bedeutet, S<sup>2</sup> und S<sup>3</sup> unabhängig voneinander Hydroxylschutzgruppen bedeuten und R<sup>1</sup> ein Wasserstoffatom oder eine Carboxylschutzgruppe darstellt. durch stereoselektive Hydrierung einer Verbindung der Formel (III) zu einer Verbindung der Formel (II-a) und gegebenenfalls Einführung einer Hydroxylschutzgruppe und b) Lactonisierung der Verbindung der Formel (II) zu einer Verbindung der Formel (I-a).

WO 2005/047276 A3



MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

— mit internationalem Recherchenbericht

**(84) Bestimmungsstaaten** (*soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart*): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL,

**(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen Recherchenberichts:**

6. Oktober 2005

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*